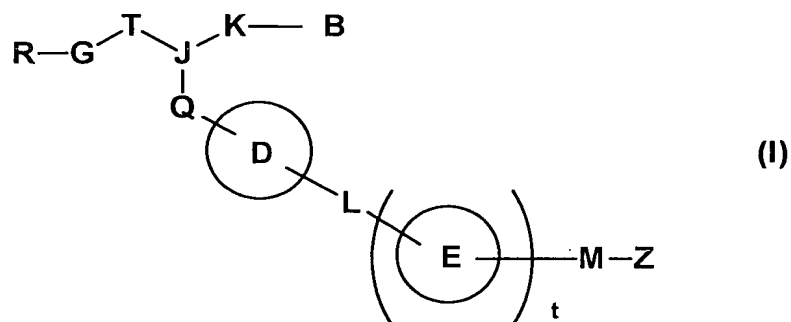


ABSTRACT

A compound of the general formula (I):



(wherein the symbols are as defined in the description), or a non-toxic salt thereof. This compound engages in LPA receptor bonding and antagonism and hence is useful in the prevention and/or treatment of urinary system disease (symptom with prostatic hypertrophy or neurogenic bladder dysfunction disease, symptom to be caused by spinal cord neoplasm, nucleous hernia, spinal canal stenosis or diabetes, occlusion disease of lower urinary tract, inflammatory disease of lower urinary tract, polyuria), carcinoma-associated disease (solid tumor, solid tumor metastasis, angiofibroma, myeloma, multiple myeloma, Kaposi's sarcoma, leucemia and carcinomatous infiltration transition), proliferative disease (disorder with aberrant angiogenesis, artery obstruction and pulmonary fibrosis), inflammation / immune system disease (psoriasis, nephropathy, hepatitis and pneumonitis symptom), disease caused by secretory dysfunction (Sjogren syndrome), brain-related disease (brain infarction, cerebral apoplexy and brain or peripheral neuropathy) or chronic disease (chronic asthma, glomerulonephritis, obesity, prostate hyperplasia, diseases caused by arteriosclerosis process, rheumatism or atopic dermatitis).

530, 249

Rec'd PCT/PTO 04 APR 2005

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2004 年 4 月 15 日 (15.04.2004)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2004/031118 A1(51) 国際特許分類⁷: C07C 65/40, 235/52, A61K
31/192, 31/216, 31/402, 31/4035, 31/404, 31/41, 31/4184,
31/4402, 31/445, 31/472, 31/517, 31/5415[JP/JP]; 〒618-8585 大阪府 三島郡 島本町桜井 3 丁目
1 番 1 号 小野薬品工業株式会社 水無瀬総合研究所
内 Osaka (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2003/006680

(74) 代理人: 大家 邦久 (OHIE, Kunihiisa); 〒103-0013 東京
都 中央区 日本橋人形町 2 丁目 2 番 6 号 堀口第 2 ビ
ル 7 階 大家特許事務所 Tokyo (JP).

(22) 国際出願日: 2003 年 5 月 28 日 (28.05.2003)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,
BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK,
DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT,
LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO,
NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL,
TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU,
ZA, ZM, ZW.

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2002-291137 2002 年 10 月 3 日 (03.10.2002) JP(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 小野
薬品工業株式会社 (ONO PHARMACEUTICAL CO.,
LTD.) [JP/JP]; 〒541-8526 大阪府 大阪市 中央区道修
町 2 丁目 1 番 5 号 Osaka (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 寺門 正彦
(TERAKADO, Masahiko) [JP/JP]; 〒618-8585 大阪府
三島郡 島本町桜井 3 丁目 1 番 1 号 小野薬品工業
株式会社 水無瀬総合研究所内 Osaka (JP). 中出 眞嗣
(NAKADE, Shinji) [JP/JP]; 〒618-8585 大阪府 三
島郡 島本町桜井 3 丁目 1 番 1 号 小野薬品工業株
式会社 水無瀬総合研究所内 Osaka (JP). 世古 卓哉
(SEKO, Takuya) [JP/JP]; 〒541-8526 大阪府 大阪市 中
央区道修町 2 丁目 1 番 5 号 小野薬品工業株式会
社内 Osaka (JP). 高岡 義和 (TAKAOKA, Yoshikazu)(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ,
SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM,
AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許
(AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB,
GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR),
OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW,
ML, MR, NE, SN, TD, TG).

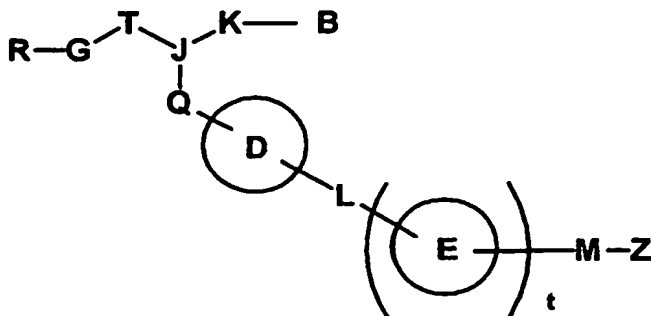
添付公開書類:

— 国際調査報告書

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される
各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: LPA RECEPTOR ANTAGONISTS

(54) 発明の名称: LPA 受容体拮抗剤



(I)

(57) Abstract: Compounds represented
by the following general formula (I) and
nontoxic salts thereof: (I) wherein each
symbol is as defined in the description.
Because of binding to LPA receptors and
antagonizing the same, the compounds
represented by the general formula (I)
are useful in preventing and/or treating
urinary diseases (symptoms accompanying
prostate-gland enlargement or neurogenic
bladder disease, symptoms caused by
spinal tumor, herniated disk, vertebral
canal stenosis or diabetes, lower urinarytract obstruction, lower urinary tract inflammatory disease, polyuria), cancer-related diseases (solid tumor, solid tumor metastasis,
angiofibroma, myeloma, multiple myeloma, Kaposi' s sarcoma, leukemia, infiltrative metastasis of cancer), proliferative diseases
(diseases accompanied by abnormal angiogenesis, arterial occlusion, pulmonary fibrosis), inflammatory immune diseases
(psoriasis, nephropathy, hepatitis, pulmonary inflammation), diseases caused by secretion failures (Sjogren' s syndrome),
brain-related diseases (cerebral infarction, cerebral hemorrhage, cerebral or peripheral neuropathy), or chronic diseases (chronic
asthma, glomerular nephritis, obesity, prostate-gland enlargement, diseases caused by the progress of arteriosclerosis, rheumatoid
and atopic dermatitis).

[続葉有]

WO 2004/031118 A1